

特許協力条約

発信人 日本国特許庁（国際予備審査機関）

出願人代理人

特許業務法人特許事務所サイクス

殿

あて名

〒 104-0031

東京都中央区京橋一丁目8番7号
京橋日殖ビル8階

PCT見解書

(法第13条)
[PCT規則66]発送日
(日.月.年)

19.08.03

出願人又は代理人
の書類記号

A31322M

応答期間

上記発送日から 2 月以内

国際出願番号

PCT/JPO3/07119

国際出願日

(日.月.年)

05.06.03

優先日

(日.月.年)

10.06.02

国際特許分類 (IPC) Int.Cl¹ A61K31/167, 31/18, 31/275, 31/381, 31/40, 31/404, 31/4164, 31/421, 31/422, 31/426, 31/433, 31/437, 31/4402, 31/445, 31/451, 31/455, 31/47, 31/498, 31/505, 31/5375, 31/5377, A61P29/00, 29/00 101, 37/06, 43/00, 43/00 111, A61K31/222

出願人 (氏名又は名称)

株式会社医薬分子設計研究所

1. これは、この国際予備審査機関が作成した 1 回目の見解書である。
2. この見解書は、次の内容を含む。
- I ☒ 見解の基礎
- II ☐ 優先権
- III ☒ 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成
- IV ☐ 発明の単一性の欠如
- V ☒ 法第13条 (PCT規則66.2(a)(ii)) に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- VI ☒ ある種の引用文献
- VII ☐ 国際出願の不備
- VIII ☐ 国際出願に対する意見
3. 出願人は、この見解書に応答することが求められる。
- いつ? 上記応答期間を参照すること。この応答期間に間に合わないときは、出願人は、法第13条 (PCT規則66.2(d)) に規定するとおり、その期間の経過前に国際予備審査機関に期間延長を請求することができる。ただし、期間延長が認められるのは合理的な理由があり、かつスケジュールに余裕がある場合に限られることに注意されたい。
- どのように? 法第13条 (PCT規則66.3) の規定に従い、答弁書及び必要な場合には、補正書を提出する。補正書の様式及び言語については、法施行規則第62条 (PCT規則66.8及び66.9) を参照すること。
- なお 補正書を提出する追加の機会については、法施行規則第61条の2 (PCT規則66.4) を参照すること。補正書及び/又は答弁書の審査官による考慮については、PCT規則66.4の2を参照すること。審査官との非公式の連絡については、PCT規則66.6を参照すること。
- 応答がないときは、国際予備審査報告は、この見解書に基づき作成される。
4. 国際予備審査報告作成の最終期限は、PCT規則69.2の規定により 10.10.04 である。

名称及びあて先

日本国特許庁 (IPEA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

安藤 倫世

4P

3230

電話番号 03-3581-1101 内線 3451

I. 見解の基礎

1. この見解書は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に回答するために提出された差替え用紙は、この見解書において「出願時」とする。)

☒ 出願時の国際出願書類

- | | | | | |
|-------------------------------------|---|-------|--------|----------------------|
| <input type="checkbox"/> 明細書 | 第 | _____ | ページ、 | 出願時に提出されたもの |
| 明細書 | 第 | _____ | ページ、 | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| 明細書 | 第 | _____ | ページ、 | _____ 付の書簡と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲 | 第 | _____ | 項、 | 出願時に提出されたもの |
| 請求の範囲 | 第 | _____ | 項、 | PCT19条の規定に基づき補正されたもの |
| 請求の範囲 | 第 | _____ | 項、 | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| 請求の範囲 | 第 | _____ | 項、 | _____ 付の書簡と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 図面 | 第 | _____ | ページ/図、 | 出願時に提出されたもの |
| 図面 | 第 | _____ | ページ/図、 | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| 図面 | 第 | _____ | ページ/図、 | _____ 付の書簡と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 明細書の配列表の部分 | 第 | _____ | ページ、 | 出願時に提出されたもの |
| 明細書の配列表の部分 | 第 | _____ | ページ、 | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| 明細書の配列表の部分 | 第 | _____ | ページ、 | _____ 付の書簡と共に提出されたもの |

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である _____ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語
☐ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき見解書を作成した。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 図面の第 _____ ページ/図

5. ☐ この見解書は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

Ⅲ. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

1. 次に、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

- ☐ 国際出願全体
- ☒ 請求の範囲 1-14 の一部

理由：

- ☐ この国際出願又は請求の範囲 _____ は、国際予備審査をすることを要しない
次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

- ☒ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 1-14 の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

請求の範囲 1 - 1 4 の発明の医薬組成物の有効成分は、極めて広範囲かつ多彩な化合物を包含し、そのすべてについて、完全な調査を行うことは困難である。一方、特許協力条約第 6 条の意味において明細書に裏付けられ、また、特許協力条約第 5 条の意味において明細書に開示されているものは、請求の範囲 1 - 1 4 の発明の医薬組成物の有効成分の中のごく僅かな部分に過ぎない。

したがって、請求の範囲１－１４及び明細書は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない。

そこで、先の国際調査報告では、請求の範囲 1 - 14 の発明については、明細書に具体的に記載された化合物に基づいて、合理的な負担の範囲内で、先行技術文献調査を行ったので、この調査の範囲で、国際予備審査を行うこととする。

- ☒ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 1-14 が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

- ☒ 請求の範囲 1-14の一部 について、国際調査報告が作成されていない。

2. ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を満たしていないので、見解書を作成することができない。

- ☐ 書面による配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。
- ☐ 磁気ディスクによる配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。

V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第13条(PCT規則66.2(a)(ii))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性(N)	請求の範囲	有
	請求の範囲 1-14	無
進歩性(IS)	請求の範囲	有
	請求の範囲 1-14	無
産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲 1-14	有
	請求の範囲	無

2. 文献及び説明

- 文献1) WO 01/12588 A1 (メルシャン株式会社) 2001.02.22,
文献2) JP 4-217916 A (日本たばこ産業株式会社) 1992.08.07
文献3) WO 02/28819 A1 (THE RESEARCH FOUNDATION OF STATE UNIVERSITY OF NEW YORK) 2002.04.11
文献4) Yakugaku Zasshi, Vol.96, No.2, (1976) p165-169
文献5) Yakugaku Zasshi Vol.95, No.12, (1975), p1477-1482
文献6) WO 01/10865 A1 (武田薬品工業株式会社) 2001.02.15
文献7) JP 2001-522834 A (アムジェン・インコーポレーテッド) 2001.11.20
文献8) Pharmaceutical Sciences, Vol.3, No.5/6, 1997, p295-299
文献9) Farmaco, Vol.44, No.5, 1989, p465-73
文献10) JP 2-138260 A (ヘキストールセル・ファーマシューティカルズ・インコーポレーテッド) 1990.05.28
文献11) JP 62-30780 A (エスエス製薬株式会社) 1987.02.09

請求の範囲1-4, 7, 8, 12-14に係る発明は、文献1により新規性及び進歩性を有さない。文献1には、NF- κ B活性化阻害作用を有する化合物として、式(2)で示されるサルチル酸アミド誘導体が記載されている。してみると、請求の範囲1-4, 7, 8, 12-14に係る発明は、文献1記載のものと同一である。

請求の範囲1-4, 7, 8, 12, 13に係る発明は、文献2により新規性及び進歩性を有さない。文献2には、抗炎症剤として有効な化合物として、被験化合物105で示される、N-(3, 5-ジクロロフェニル)-2, 4, 6, -トリヒドロキシ-3-ニトロベンズアミドが記載されている。

請求の範囲1-5, 7-9, 12, 13に係る発明は、文献3により新規性及び進歩性を有さない。文献3には、抗炎症作用を有する化合物としてサルチル酸誘導体が記載されている。

(以下、第V欄の続きに続く。)

VI. ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書(PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 02/49632 A1 「EX」	27. 06. 02	18. 12. 01	18. 12. 00
WO 02/076918 A1 「EX」	03. 10. 02	27. 03. 02	27. 03. 01

2. 書面による開示以外の開示(PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

補充欄 (いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること)

第 V 欄の続き

(第V欄の続き)

請求の範囲 1-4, 7, 12, 13に係る発明は、文献4、5により新規性及び進歩性を有さない。文献4には、抗炎症作用を有する化合物として、AB-19, AB-22, AB-23 で示される化合物が記載されている。また、文献5には、抗炎症作用を有する化合物として、AB-19, AB-23, AB-24, AB-50, AB-43で示される化合物が記載されている。

請求の範囲 1-4, 10-14に係る発明は、文献6により新規性及び進歩性を有さない。文献6には、リウマチや炎症等に有用な化合物として、参考実施例 23-345で示される化合物が記載されている。

請求の範囲 1-4, 10, 12-14に係る発明は、文献7により新規性及び進歩性を有さない。文献7には、リウマチや炎症等に有用な化合物として、置換基にピリジン環を有するアセチル酸誘導体が記載されている。

請求の範囲 1-4, 6, 10, 12-14に係る発明は、文献8により新規性及び進歩性を有さない。文献8には、抗炎症剤として有用なナフタレンカルボキシアミド化合物が記載されている。

請求の範囲 1-3, 10, 12-14に係る発明は、文献9により新規性及び進歩性を有さない。文献9には、炎症等に有用な化合物として、サルチル酸アミド化合物が記載されている。

請求の範囲 1-3, 10, 12, 13に係る発明は、文献10、あるいは文献11により新規性及び進歩性を有さない。文献10には、炎症等に有用な化合物として、実施例 1, 2, 4で示される化合物が記載されている。また、文献11には、炎症等に有用な化合物として、化合物 31で示される化合物が記載されている。

上記文献 2-11には、NF- κ B活性化阻害作用についての記載はないが、本願発明医薬は、実際に医薬として使用する際には、リウマチや炎症等の疾患に適用されるものと認められるから、その医薬用途は、文献 2-11記載のものと区別することはできない。してみると、請求の範囲 1-14に係る発明は、文献 2-11記載のものと同一である。

文献 1-11に記載の化合物は、抗炎症作用を有し、本願の一般式(I)に相当するサルチル酸アミドを基本骨格とする点で共通である。

そして、文献 1-11の記載から、当該サルチル酸アミド誘導体における環Zはベンゼンであってもナフタレンであっても、また、種々置換基を有していても、抗炎症作用を有するものと認められるし、環Eについても、2, 5-又は3, 5-置換ベンゼンであっても、チアゾールであっても抗炎症作用を有するものと認められる。そうしてみると、文献 1-11に記載された環構造、置換基を、それぞれ置換してみるとは、当業者が容易になし得ることである。

また、当該化合物について、文献 6-9に記載された抗リウマチ活性を想到することも当業者にとって容易である。